

⑤ Int. Cl.

A 61 K 35/78

識別記号

ADU

庁内整理番号

7138-4C

④ 公開 昭和61年(1986)4月30日

審査請求 有 発明の数 2 (全8頁)

④ 発明の名称 抗癌剤の製造法

② 特 願 昭59-207038

③ 出 願 昭59(1984)10月4日

⑦ 発 明 者 佐々木 査 東京都練馬区豊玉北5丁目8番地

⑧ 出 願 人 佐々木 査 東京都練馬区豊玉北5丁目8番地

⑨ 代 理 人 弁理士 中島 喜六 外1名

明 細 書

1. 発明の名称

抗癌剤の製造法

2. 特許請求の範囲

(1) 山豆根(*Sophora*属)とヒオオギスイセン(*Crocosmia aurea* Planch.)を基材とし、これにサボテン(*Opuntia Ficus-indica* Mill. var. *Saboten*)の実を加えたものの水抽出液又はその乾燥物より成る抗癌剤の製造法

(2) 山豆根(*Sophora*属)とヒオオギスイセン(*Crocosmia aurea* Planch.)を基材とし、これにカリン(*Pseudocydonia sinensis* Schneid)の実、ひし(*Trapa natans* L. var. *bispinosa*)の実、苦参(薬用人参)(*Panax Schinseng* H. et A.)を加えたものの水抽出液又は其の乾燥物より成る抗癌剤の製造法

3. 発明の詳細な説明

本発明は、

- (1) 山豆根とヒオオギスイセンを基材とし、これにサボテンの実を加えたものの水抽出液又はその乾燥物より成る抗癌剤の製造法
- (2) 上記の基材にカリンの実、ひしの実、苦参(薬用人参)を加えたものの水抽出液又はその乾燥物より成る抗癌剤の製造法の発明である。

本発明で使用する山豆根は、マメ科 *Sophora* 属の植物であって、現在主として中国から輸入されており、苗葉が豆根のような形状をしている。

ヒオオギスイセン(*Crocosmia aurea* Planch.)は、高さ1メートル前後をなす南アフリカ原産の多年生草本である。

サボテン(*Opuntia Ficus-indica* Mill. var. *Saboten*)は、メキシコ原産の多年生草本であって茎は高さ2メートルに達し、横円形で扁平、肥厚した茎節を有することを特徴とする。

カリン(*Pseudocydonia sinensis* Schneid)

BEST AVAILABLE COPY

は、高さ8メートル位に達する中国原産の落葉高木で、その実は長さ10cmの大きな楕円形をなし、果肉はかたい。

ひし (*Trips natans* L. var. *Bispinosa*) は、池沼にはえる一年生草本であって、その実にはトゲがある。

苦参 (薬用人参) (*Panax Schinseng* Nees) は、中国および朝鮮原産の多年生草本で高さ60cm程度の薬用植物である。

実施例1

山豆根 (全草を陰干したもの) 10g
ヒオオギスイセン 30g
ツボテン 40g
を水抽出して、抽出液500mlを得た。

このうち100mlを凍結乾燥することにより、乾燥エキス0.8550gを得た。

実施例2

山豆根 (全草を陰干したもの) 10g
ヒオオギスイセン 25g

- 3 -

に注射し、7日間投与を中止し、以後の生死を観察した。

飼料は固形飼料 (オリエンタル酵母株式会社製) を使用し、水は常水を自由に摂取させた。

比較実験

対照群 (無投与群) は19日以内に全部死亡し、平均生存日数は1.28±4.4日であった。

VR-II凍結乾燥エキス2mg/0.2ml生食/マウス/日、7日間投与群では平均生存日数39.4±23.1日でありT/C%307.8の極めて優れた延命効果が得られた。しかも60日生存マウス2匹の剖兎の結果、腹水の貯留、固形腫瘍の存在は全く認められず、内臓諸器官に肉眼的変化は全く認められなかった。

VR-S凍結乾燥エキス1.5ml/0.2ml生食/マウス/日、7日間投与群では平均生存日数28.6±9日でありT/C%223.4日

カリン 10g
ひしの実 10g
人 参 8g

を水抽出して、抽出液600mlを得た。

このうち75mlを凍結乾燥することにより、乾燥エキス1.0870gを得た。

本願の方法による発明品の抗癌作用を次のように試験し作用効果を確認した。

以下特許請求の範囲第1項によって得た抽出液をVR-S、同第2項によって得た抽出液をVR-IIと略称する。

実験動物には、1CR-SP雄5週令マウス (浜松実験動物協同組合より購入)、1群5匹づつを使用した。

各マウスに植継後、7日目のサルコーマ180腹水から2.5×10⁵ヶ/mlの細胞浮遊液を調整したもの0.2ml (5×10⁵ヶ) を腹腔内に接種し、24時間後から上記薬物溶液を0.1ml又は0.2mlづつ1日1回腹腔内

- 4 -

に統計的に有意な延命効果が認められたが、60日間の生存マウスはいなかった。

上記の様に本発明の製品は動物実験の結果抗癌剤として顕著な結果を奏する事を確認した。

尚、山豆根メタノール可溶部 (アルカロイド画分) 1mg/0.2ml生食マウス/日、7日間投与群では平均生存日数14.2±2.6日、T/C%110.9であり、統計的に有意な延命効果は認められなかった。

山豆根メタノール可溶部 (アルカロイド画分) 0.5mg/0.1ml生食/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数29.4±2.5日でありT/C%229.8、60日間生存マウス (1匹) の剖兎の結果は正常であったが、統計的に有意な延命効果とは認められない。

山豆根メタノール不溶部 (非アルカロイド画分) 2mg/0.2ml生食/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数31.0±1

BEST AVAILABLE COPY

7. 1日、T/C% 242.2であり、統計的にも有意のすぐれた延命効果を示したが、60日間生存マウス(1匹)には著量の血液を凝じた腹水と腹腔内にそら豆大の固形腫瘍が認められた。

苦参XAD-2吸着エタノール溶出面分(ソルカロイド面分) 1mg/0.2ml生食/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数23.2±20.6日、T/C% 181.3と高かったが、統計的には有意性が認められず、60日間生存マウス(1匹)(剖見結果正常)を除いては14.0±1.6日T/C% 109.4と全く無効であった。

苦参XAD-2吸着エタノール溶出面分(アルカロイド面分) 0.5mg/0.1ml生食/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数14.0±1.4日、T/C% 107.4で全く無効であった。

苦参XAD-2通水浸液凍結乾燥エキス(非アルカロイド面分) 2mg/0.2ml生食

/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数46.2±18.5日、T/C% 360.9と極めて高い値を示し統計的に有意の延命効果と認められるが、60日生存マウス2匹にはいれも巨大な固形腫瘍が認められた。

苦参XAD-2通水浸液凍結乾燥エキス(非アルカロイド面分) 1mg/0.1ml生食/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数38.2±21.4日、T/C% 298.4という統計的に有意な延命効果が認められ、しかも60日生存マウスの剖見でも異常は発見されなかった。

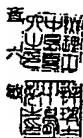
マイトマイシン-C(MMC) 0.02mg/マウス/日、7日間投与群では、平均生存日数50.3±11.8日、T/C% 392.2と最も高い値を示し極めてすぐれた延命効果がみとめられた。しかし60日生存マウス2匹中の1匹には血液を含む大量の腹水と大きな固形腫瘍がみとめられた。他の1匹は正常であった。

- 7 -

以上の比較実験結果により、本発明の製造方法によって得られたVR-H、VR-Sいずれの複合生薬水抽出エキスにもマウス腹水腫に対するすぐれた延命効果が認められ、それは本発明の構成成分である山豆根、苦参単独の抽出液に比しても顕著な効果を有するものであった。

- 8 -

特許出願人 佐々木
代理人 中島
関 中島



- 9 -